

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005年3月10日 (10.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/020882 A3(51) 国際特許分類⁷: C07C 229/14,
229/22, 229/36, 233/47, 255/16, 255/41, 271/22, C07D
205/04, 211/04, 217/04, 405/06, A61K 31/11, 31/135,
31/197, 31/198, 31/222, 31/27, 31/277, 31/397, 31/472,
45/00, A61P 37/06, 37/08, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/012768

(22) 国際出願日: 2004年8月27日 (27.08.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2003-306088 2003年8月29日 (29.08.2003) JP
特願2004-110573 2004年4月2日 (02.04.2004) JP
特願2004-169958 2004年6月8日 (08.06.2004) JP
特願2004-198523 2004年7月5日 (05.07.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野
薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道修
町2丁目1番5号 Osaka (JP).

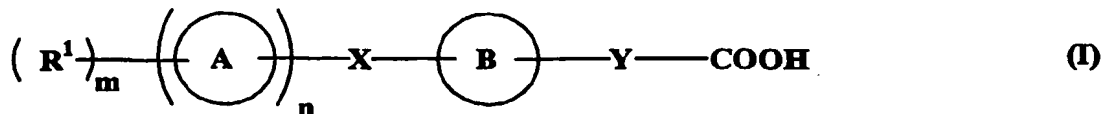
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): 中出 眞嗣
(NAKADE, Shinji) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つく
ば市 和台 17番地2 小野薬品工業株式会社内
Ibaraki (JP). 水野 弘貴 (MIZUNO, Hirotaka) [JP/JP]; 〒
300-4247 茨城県 つくば市 和台 17番地2 小野薬品
工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小野 岳児 (ONO, Takeji)
[JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市 和台 17番地
2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 南 真志
(MINAMI, Masashi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば
市 和台 17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki(JP). 佐賀 寛 (SAGA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨
城県 つくば市 和台 17番地2 小野薬品工業株
式会社内 Ibaraki (JP). 萩谷 洋 (HAGIYA, Hiroshi)
[JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市 和台 17番地
2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小宮 貴
樹 (KOMIYA, Takaki) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つ
くば市 和台 17番地2 小野薬品工業株式会社内
Ibaraki (JP). 巾下 広 (HABASHITA, Hiromu) [JP/JP];
〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井三丁目1番
1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 倉田 晴
登 (KURATA, Haruto) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三
島郡 島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式
会社内 Osaka (JP). 大槻 和裕 (OHTSUKI, Kazuhiro)
[JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井三丁目
1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 久須
美 健介 (KUSUMI, Kensuke) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪
府 三島郡 島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工
業株式会社内 Osaka (JP).(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihiisa); 〒103-0013 東京
都 中央区 日本橋人形町2丁目14番6号 セルバ人
形町6階 大家特許事務所 Tokyo (JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

[続葉有])

(54) Title: COMPOUND CAPABLE OF BINDING S1P RECEPTOR AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: S1P受容体結合能を有する化合物およびその医薬用途

(57) Abstract: A compound capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6). For example, a compound of the general formula (I), its salt or solvate, or a prodrug thereof is capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6) and is thus useful in the prevention and/or treatment of immunological reaction to transplant, graft versus host disease, autoimmune disease, allergosis, etc. (I) (wherein the ring A is a cyclic group; the ring B is an optionally substituted cyclic group; X is a spacer with a main chain of 1 to 8 atoms, etc.; Y is a spacer with a main chain of 1 to 10 atoms, etc.; and n is 0 or 1 provided that when n is 0, m is 1 and R¹ is a hydrogen atom or a substituent and that when n is 1, m is 0 or an integer of 1 to 7 and R¹ is a substituent, in which when m is 2 or greater, R¹s may be identical with or different from each other).

[続葉有])



CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

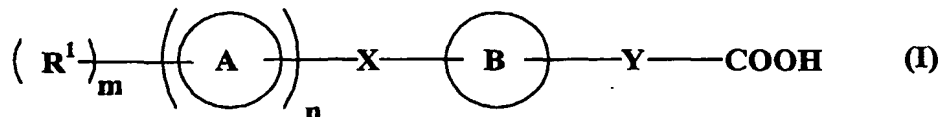
— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

(88) 国際調査報告書の公開日: 2005 年 4 月 21 日

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

S 1 P 受容体（特に EDG-6、好ましくは EDG-1 および EDG-6）結合能を有する化合物、例えば一般式 (I) で示される本発明化合物、その塩、その溶媒和物、またはそれらのプロドラッグは S 1 P 受容体（特に EDG-6、好ましくは EDG-1 および EDG-6）結合能を有し、移植に対する拒絶反応、移植片対宿主病、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患等の予防および／または治療に有用である。



(式中、環 A は環状基；環 B は置換基を有していてもよい環状基；X は主鎖の原子数 1～8 のスペーサー等；Y は主鎖の原子数 1～10 のスペーサー等；n は 0、1；n が 0 の場合、m は 1、かつ R¹ は水素原子、置換基；n が 1 の場合、m は 0、1～7 の整数、かつ R¹ は置換基、かつ m が 2 以上のとき R¹ は同じでも異なってもよい)。